

This Page Is Inserted by IFW Operations
and is not a part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

**As rescanning documents *will not* correct images,
please do not report the images to the
Image Problem Mailbox.**

BREVET SPÉCIAL DE MÉDICAMENT

P.V. n° 58.277

N° 5.762 M

Classification internationale : A 61 k // C 07 d

Nouveaux médicaments dérivés de la phénanthridone.

Société dite : ASPRO-NICHOLAS LIMITED résidant en Grande-Bretagne.

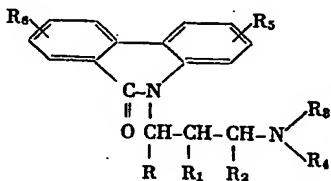
Demandé le 20 avril 1966, à 14^h 4^m, à Paris.

Délivré par arrêté du 5 février 1968.

(*Bulletin officiel de la Propriété industrielle [B.S.M.], n° 11 du 11 mars 1968.*)
(*Demande de brevet déposée en Grande-Bretagne le 20 avril 1965, sous le n° 16.662/65, au nom de la demanderesse.*)

Cette invention concerne des dérivés nouveaux biologiquement actifs de la phénanthridone, des préparations pharmaceutiques contenant de tels dérivés et des méthodes de traitement faisant appel à l'administration desdits dérivés et préparations. Cette invention concerne en plus les procédés de fabrication desdits dérivés nouveaux de la phénanthridone.

Les dérivés de la phénanthridone (c'est-à-dire les dérivés de la 5,6 - dihydro - 6 - oxo - phénanthridine) de la présente invention ont la formule générale :



dans laquelle R, R₁ et R₂ représentent chacun un atome d'hydrogène ou un radical méthyle; R₃ et R₄ représentent chacun un atome d'hydrogène; un radical alcoyle inférieur; un radical cycloalcoyle ou un radical aralcoyle; ou ensemble avec l'atome d'azote adjacent R₃ et R₄ forment un noyau hétérocyclique, lequel noyau peut en plus contenir un autre atome comme un atome d'oxygène ou d'azote (lequel atome d'azote supplémentaire peut être substitué par un radical alcoyle inférieur ou hydroxyalcoyle); et R₅ et R₆ représentent chacun un atome d'hydrogène ou d'halogène ou un radical alcoyle inférieur, alkoxy, thioalcoyle, trifluorométhyle, nitro, amino, hydroxyle, cyano ou sulfamyle. Par le terme « alcoyle inférieur » utilisé ici nous comprenons des radicaux alcoyle saturés et non saturés contenant jusqu'à 4 atomes de carbone et de préférence 1 à 2 atomes de carbone. De tels dérivés de la phénanthridone peuvent être employés dans

l'invention soit tels quels, soit de préférence sous forme de sels d'addition acide convenables à caractère non toxique pharmaceutiquement acceptable.

La présente invention concerne particulièrement les composés correspondant à la formule I, dans laquelle R, R₁ et R₂ sont tels que spécifiés ci-dessus, R₃ et R₄ représentent chacun un atome d'hydrogène, un radical alcoyle inférieur ou aralcoyle ou, ensemble avec un atome d'azote, R₃ et R₄ représentent un noyau hétérocyclique qui peut contenir un autre atome d'azote ou un atome d'oxygène; R₅ est tel que spécifié précédemment et R₆ est un atome d'hydrogène ou d'halogène ou un radical alcoyle inférieur ou un radical trifluorométhyle.

Cette invention concerne plus particulièrement des composés de formule I dans laquelle R, R₁, R₂ et R₆ sont des atomes d'hydrogène; R₃ et R₄ représentent chacun un atome d'hydrogène ou un alcoyle inférieur ou un radical aralcoyle ou, ensemble avec un atome d'azote, R₃ et R₄ forment un noyau hétérocyclique qui peut contenir un autre atome d'azote ou un atome d'oxygène, et R₅ est un atome d'hydrogène ou d'halogène ou un radical alcoyle inférieur, nitro, amino ou hydroxyle.

Quand R₃ et R₄ forment ensemble avec un atome d'azote adjacent un noyau hétérocyclique, le noyau contient de préférence 5 à 7 atomes cyclisés.

Il a été trouvé que les composés de formule I conformes à la présente invention possèdent des propriétés biologiques utiles, en ce qu'il peuvent agir sur le système nerveux central comme agents anti-dépressifs. Des composés agissant de cette façon peuvent avoir une utilisation thérapeutique très précieuse comme médicament psychotropique puissant et, en conséquence, cette invention fournit aussi une méthode de traitement dans laquelle il est administré une dose de l'un des composés actifs efficace dans le cas particulier.

Il a été trouvé que le composé dans lequel R, R₁, R₂, R₅ et R₆ sont des atomes d'hydrogène et